

PF-2545920; PF2545920

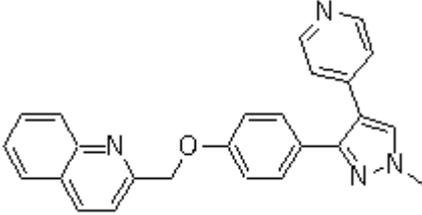
产品编号: MB7418

质量标准: >98%, 选择性 PDE10A 抑制剂

包装规格: 10MG;50MG;200MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C25H20N4O	结构式	
分子量	392.45		
CAS No.	1292799-56-4		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO: 78 mg/mL warmed (198.75 mM) Water Insoluble Ethanol: 78 mg/mL (198.75 mM)		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介: PF-2545920 是一种有效的, 选择性的 PDE10A 抑制剂, 比作用于 PDE 选择性高 1000 倍以上。

别名: 2-((4-(1-methyl-4-(pyridin-4-yl)-1H-pyrazol-3-yl)phenoxy)methyl)quinoline

物理性状及指标:

外观:白色至类白色固体

溶解性:DMSO: 78 mg/mL warmed (198.75 mM); Water Insoluble; Ethanol: 78 mg/mL (198.75 mM)

含量:>98%

储存条件: -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	PF-2545920 是一种有效的, 选择性的 PDE10A 抑制剂, IC50 为 0.37 nM, 比作用于 PDE 选择性高 1000 倍以上。
靶点	PDE10A (Cell-free assay) 0.37 nM
体外研究	PF-2545920 对 PDE10A 表现出优异的效能和选择性, IC50 为 1.26 nM。
体内研究	在雄性 CF-1 小鼠体内, PF-2545920 以 0.3, 3, 和 5 mg/kg 剂量腹腔内给药, 引起 GluR1 磷酸化水平分别显著增加 3, 5.4, 和 4.1 倍。1 μM 浓度的 MP-10 处理大鼠纹状体切片 30 分钟, GluR1S845 在细胞表面的磷酸化水平显著增加 2 倍, 而不改变细胞表面总的 GluR1。在雄性 CF-1 小鼠体内, MP-10 以 0.3, 3, 和 5 mg/kg 的剂量腹腔内给药, 导致 CREBS133 磷酸化统计学

显著的增加, 分别增加 3, 4, 和 2.6 倍。在 CF-1 小鼠的纹状体中, MP-10 以 3 mg/kg 的剂量腹腔内给药增加脑啡肽和 P 物质 mRNA 水平的增加。MP-10 以 0.3-1 mg/kg 的剂量腹腔内给药减少规避响应, 在小鼠 CAR 模型中具有显著的治疗效果。用 0.03 mg/kg 剂量 MP-10 处理的小鼠比群居小鼠花费更多的时间在无意义的事情上, MP-10 也会剂量依赖性降低自发活性。在雄性 CD-1 小鼠体内, PDE10A 以 1 mg/kg 的剂量皮下给药使纹状体的 cGMP 提高 3 倍, 而 PDE10A 以 3.2 mg/kg 的剂量皮下给药对纹状体 cGMP 的最大提高大约为 5 倍。在 Sprague-Dawley 大鼠体内, PDE10A 以 0.1 mg/kg 的剂量静脉注射表现出 36 ml/min/Kg 的清除率, 在 Dog Beagle 体内, DE10A 以 0.3 mg/kg 的剂量静脉注射在体内表现出 7.2 ml/min/Kg 的清除率, 伴随适当的体积分布容积, 在猕猴体内, DE10A 以 0.03 mg/kg 的剂量静脉注射在体内表现出 13.9 ml/min/Kg 的清除率, 伴随适当的体积分布容积。在 Sprague-Dawley 大鼠体条件性回避反应试验(CAR)中, PDE10A 在显著低于总血浆暴露的浓度 (115 nM)下具有活性, ED50 为 1 mg/kg。

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB4342	GSK256066
MB3418	PF04447943
MB5676	Apremilast (CC-10004)

用途及描述: 科研试剂, 广泛应用于分子生物学, 药理学等科研方面, 严禁用于人体。PF-2545920 是一种有效的, 选择性的 PDE10A 抑制剂, 本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体浓度 \ 质量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.5481 mL	12.7405 mL	25.4810 mL
5 mM	0.5096 mL	2.5481 mL	5.0962 mL
10 mM	0.2548 mL	1.2740 mL	2.5481 mL
50 mM	0.0510 mL	0.2548 mL	0.5096 mL

经典实验操作 (仅供参考)

动物实验	Animal Models: 颈动脉插管的雄性 Sprague-Dawley 大鼠 Formulation: 5:5:90 DMSO:1N HCl:生理盐水 Dosages: 0.1 mg/kg Administration: 喂食 4 小时之前通过颈动脉插管单剂量静脉内注射
-------------	---

【注意】

- 我司产品为非无菌包装, 若用于细胞培养, 请提前做预处理, 除去热原细菌, 否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息, 我司不保证所提供信息的权威性, 以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装: 您收到货物后最好不要自己进行分包, 因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质; 如您有特殊包装要求, 请在订购时候与我们客服代表阐明, 当然价格会做适当调整。对于开盖后, 长期未

使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 <5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。

